

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
14 octobre 2004 (14.10.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2004/087702 A3**

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 471/04, 401/12, C07B 45/04

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2004/000778

(22) Date de dépôt international : 26 mars 2004 (26.03.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0303914 28 mars 2003 (28.03.2003) FR  
0314679 15 décembre 2003 (15.12.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : **SIDEM PHARMA** [LU/LU]; 63, rue de Rollingergrund, L-L2441 LUXEMBOURG (LU).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **COHEN**, Avraham [IL/IL]; 16/5 Fishman Maïmom Street, TEL AVIV (IL). **CHARBIT**, Suzy [FR/FR]; 10, rue Floris Osmond, F-94000 CRETEIL (FR). **SCHUTZE**, François [FR/FR]; 4, rue Charles Baudelaire, F-78860 SAINT-NOM-LA-BRETECHE (FR). **MARTINET**, Frédéric [FR/FR]; 112, rue de Réaumur, F-75002 PARIS (FR).

(74) Mandataires : **L'HELGOUALCH**, Jean etc.; 109, boulevard Haussmann, F-75008 Paris (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Publiée :**

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale: 11 novembre 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

(54) Title: METHOD FOR THE ENANTIOSELECTIVE PREPARATION OF SULPHOXIDE DERIVATIVES

(54) Titre : PROCEDE DE PREPARATION ENANTIOSELECTIVE DE DERIVES DE SULFOXYDES.

(57) Abstract: The invention relates to a method for the enantioselective preparation of substituted sulfoxide derivatives. The method comprises carrying out an enantioselective oxidation of a sulphide of general formula (I): A - CH<sub>2</sub> - S - B (I), where A = a variously-substituted pyridyl nucleus and B = a heterocyclic group with a benzimidazole or imidazopyridyl nucleus, by means of an oxidising agent in the presence of a catalyst based on tungsten or vanadium and a chiral ligand, followed, where necessary, by salt formation with a base to give the sulfoxide: A - CH<sub>2</sub> - SO - B (Ia). The above is of application to the enantioselective preparation of compounds such as the enantiomers of tenatoprazole and other comparable sulfoxides.

(57) Abrégé : L'invention concerne un procédé de préparation énantiosélective de dérivés substitués de sulfoxydes. Le procédé consiste à effectuer une oxydation énantiosélective d'un sulfure de formule générale (I) ci-après A - CH<sub>2</sub> - S - B (I) dans laquelle A est un noyau pyridyle diversement substitué et B un reste hétérocyclique comportant un noyau benzimidazole ou imidazo-pyridyle, au moyen d'un agent oxydant en présence d'un catalyseur et d'un ligand chiral, suivie le cas échéant d'une salification par une base, pour obtenir le sulfoxyde A - CH<sub>2</sub> - SO - B (Ia). Application; la préparation énantiosélective de composés tels que les énantiomères du ténatoprazole et d'autres sulfoxydes comparables.

WO 2004/087702 A3